

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005 年 9 月 15 日 (15.09.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/085267 A1

- (51) 国際特許分類: C07H 17/02, A61K 31/7056, 31/706, A61P 3/04, 3/06, 3/10, 7/10, 9/04, 9/10, 9/12, 13/12, 19/06, 25/02, 27/02, 27/12, 43/00
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2005/004145
- (22) 国際出願日: 2005 年 3 月 3 日 (03.03.2005)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:  
特願2004-61426 2004 年 3 月 4 日 (04.03.2004) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): キッセイ薬品工業株式会社 (KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒399-8710 長野県 松本市 芳野 1 9 番 4 8 号 Nagano (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 伏見 信彦 (FUSHIMI, Nobuhiko) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南

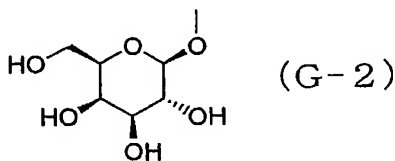
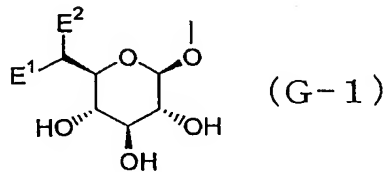
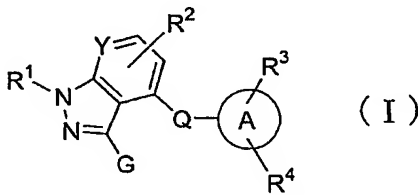
安曇郡 穂高町 大字 柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 寺西 弘幸 (TERANISHI, Hiroataka) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇郡 穂高町 大字 柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 清水 和夫 (SHIMIZU, Kazuo) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇郡 穂高町 大字 柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 米窪 滋 (YONEKUBO, Shigeru) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇郡 穂高町 大字 柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 伊東 史顕 (ITO, Fumiaki) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇郡 穂高町 大字 柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 伊佐治 正幸 (ISAJI, Masayuki) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇郡 穂高町 大字 柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP).

- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,

[続表有]

(54) Title: NITROGENOUS FUSED-RING DERIVATIVES, MEDICINAL COMPOSITIONS CONTAINING THE DERIVATIVES, AND USE THEREOF AS DRUGS

(54) 発明の名称: 含窒素縮合環誘導体、それを含有する医薬組成物およびその医薬用途



(57) Abstract: Nitrogenous fused-ring derivatives represented by the general formula (I) which exert human SGLT inhibiting activity and are useful as preventive or therapeutic agents for diseases caused by hyperglycemia, for example, diabetes, postprandial hyperglycemia, impaired glucose tolerance, complications of diabetes, and obesity; pharmacologically acceptable salts of the derivatives; prodrugs of both; medicinal compositions containing them; and use thereof as drugs: (I) wherein R<sup>1</sup> is H, optionally substituted alkyl, alkenyl, or the like; R<sup>2</sup> is H, halogeno, or alkyl; R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> are each H, OH, halogeno, optionally substituted alkyl, or the like; Y is CH or N; Q is alkylene, alkenylene, or the like; A is aryl or heteroaryl; and G is a group represented by the general formula (G-1) or (G-2): (G-1) (G-2) (wherein E<sup>1</sup> is H, F, or OH; and E<sup>2</sup> is H, F, methyl, or the like).

(57) 要約: 本発明は、ヒトSGLT活性阻害作用を発現し、糖尿病、食後高血糖、耐糖能異常、糖尿病性合併症、肥満症等の、高血糖症に起因する疾患の予防又は治療剤として有用な、下記一般式(I)で表される含窒素縮合環誘導体またはその薬理学的に許容される塩、或いはそれらのプロドラッグ〔式中、R<sup>1</sup>はH、置換可アルキル基、アルケニル基等; R<sup>2</sup>はH、ハロゲン原子又はアルキル基; R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>はH、OH、ハロゲン原子、置換可アルキル基等; YはCH又はN; Qはアルキレン、アルケニレン等; 環Aはアリール基又はヘテロアリール基; Gは下記一般式(G-1)又は(G-2)で表される基(式中、E<sup>1</sup>はH、F、OH; E<sup>2</sup>はH、F、メチル基等)〕、並びにそれを含有する医薬組成物及びその医薬用途を提供するものである。



LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,  
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,  
SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,  
US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),  
OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML,  
MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告書

- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU,

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。